

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITEMENT DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
16 octobre 2003 (16.10.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2003/084943 A3**

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
**C07D 295/22, C07C 233/65, 69/76, 63/72, 63/331,  
65/24, A61K 31/165, A61P 25/00, A61K 31/445**

(74) Mandataire : VARADY, Peter; Sanofi-Synthelabo, 174,  
avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(21) Numéro de la demande internationale :  
**PCT/FR2003/001134**

(81) États désignés (*national*) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,  
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,  
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Date de dépôt international : 10 avril 2003 (10.04.2003)

(84) États désignés (*regional*) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,  
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet  
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,  
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(25) Langue de dépôt : français

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

(26) Langue de publication : français

(88) Date de publication du rapport de recherche  
internationale: 1 avril 2004

(30) Données relatives à la priorité :  
02/04567 11 avril 2002 (11.04.2002) FR

*En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.*

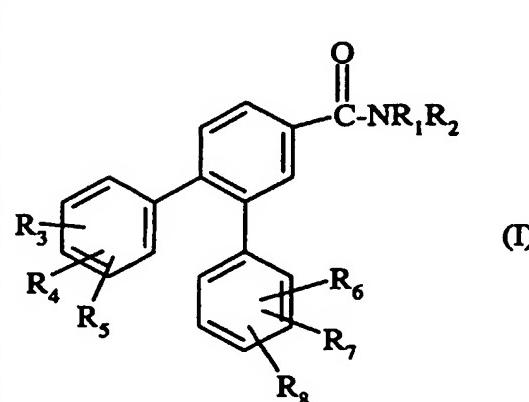
(71) Déposant (*pour tous les États désignés sauf US*) :  
**SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174, avenue de  
France, F-75013 Paris (FR).**

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (*pour US seulement*) : **BARTH,  
Francis [FR/FR]; 5, allée des Terres Rouges, F-34680  
Saint-Georges d'Orques (FR). MARTINEZ, Serge  
[FR/FR]; 4, rue Raoul, F-34000 Montpellier (FR). RIN-  
NALDI-CARMONA, Murielle [FR/FR]; 2, rue des  
Fontardies, F-34680 Saint-Georges d'Orques (FR).**

(54) Title: TERPHENYL DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF, COMPOSITIONS CONTAINING SAME

(54) Titre : DERIVES DE TERPHENYLE, LEUR PREPARATION, LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES EN CONTE-  
NANT



(57) Abstract: The invention concerns terphenyl derivatives of formula (I) and their preparations as well as pharmaceutical compositions containing them. Said compounds have a cannabinoid CB<sub>1</sub> receptor antagonist activity.

(57) Abrégé : L'invention est relative à des dérivés de terphényle de formule: (I) ainsi qu'à leur préparation et aux compositions pharmaceutiques les contenant. Ces composés présentent une activité antagoniste des récepteurs CB<sub>1</sub> aux cannabinoïdes.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/AU2003/01134

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER				
IPC 7	C07D295/22	C07C295/65	C07C69/76	C07C63/72
	C07C65/24	A61K31/165	A61P25/00	C07C63/331 A61K31/445

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D C07C A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	FR 2 800 375 A (SANOFI SYNTHELABO) 4 May 2001 (2001-05-04) the whole document	1, 4, 5, 7-10
A	RINALDI-CARMONA M ET AL: "SR141716A, A POTENT AND SELECTIVE ANTAGONIST OF THE BRAIN CANNABINOID RECEPTOR" FEBS LETTERS, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 350, no. 2/3, 1994, pages 240-244, XP002044764 ISSN: 0014-5793 cited in the application the whole document	1, 4, 5, 7-10

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

### Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the International filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 October 2003

Date of mailing of the international search report

22/10/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fitz, W

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.  
PCT/EP03/01134

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	BRENNA, ELISABETTA ET AL: "New route to o-terphenyls: application to the synthesis of 6,7,10,11-tetramethoxy-2-(methoxycarbonyl) triphénylene" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1: ORGANIC AND BIO-ORGANIC CHEMISTRY (1998), (5), 901-904, XP002221111 page 904; colonne 1: "4'-Methoxycarbonyl-1,1':2',1"-terphenyl"; "3,3",4,4"-Tetramethoxy-4'-methoxycarbonyl-1,1':2',1"-terphenyl" ---	1,4,5, 7-10
A	US 4 916 145 A (TILLEY JEFFERSON W ET AL) 10 April 1990 (1990-04-10) colonne 32, ligne 17: "3,4-diphenylbenzoic acid methyl ester", ligne 26: "3,4-diphenylbenzoic acid"; colonne 47, exemples 63,64,65; colonne 49, exemples 75,76,77 ---	1,4,5, 7-10
A	SATO, TAKEO ET AL: "Photoaryl coupling reactions. VII. New route to polycondensed aromatics Photolytic formation of triphénylene and dibenzofg, op!naphthacene ring systems" BULL. CHEM. SOC. JAP. (1971), 44(9), 2484-90, XP002221112 page 2489, colonne 2, ligne 60: "ethyl o-terphenyl-4-carboxylate" ---	1,4,5, 7-10
P,X	BASS, CAROLINE E. ET AL: "SR-141716A-induced stimulation of locomotor activity. A structure-activity relationship study" PHARMACOLOGY, BIOCHEMISTRY AND BEHAVIOR (2002), 74(1), 31-40 , XP002256669 page 36, Tableau 4: 0-1803 -----	1-3,7-10

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No. ....  
PCT/... 03/01134

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)		Publication date
FR 2800375	A 04-05-2001		FR 2800375 A1 AU 1286001 A EP 1230244 A2 WO 0132663 A2 HU 0203509 A2 JP 2003513099 T		04-05-2001 14-05-2001 14-08-2002 10-05-2001 28-03-2003 08-04-2003
US 4916145	A 10-04-1990		NONE		

**RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE**

Demande internationale n°

**A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE**

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

**B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE**

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si cela est réalisable, termes de recherche utilisés)

**C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS**

Catégorie*	Documents cités avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	n° des revendications visées

Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents.

Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe.

\* Catégories spéciales de documents cités :

"A" document définissant l'état général de la technique, n'étant pas considéré comme particulièrement pertinent

"E" document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date

"L" document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)

"O" document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens

"P" document publié avant la date de dépôt international, mais après la date de priorité revendiquée

"T" document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour permettre de comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention

"X" document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

"Y" document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier

"&" document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche a été effectivement achevée

Date d'expédition du rapport de recherche

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Fonctionnaire autorisé

n° de télecopieur

n° de téléphone